

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
13. Januar 2005 (13.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/003071 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07C 49/17,  
C07D 417/06, 493/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/006685

(22) Internationales Anmeldedatum:  
19. Juni 2004 (19.06.2004)

(25) Elnrelchungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 31 004.5 3. Juli 2003 (03.07.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT  
[DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KLAR, Ulrich  
[DE/DE]; Isegrimsteig 8a, 13503 Berlin (DE). BUCH-  
MANN, Bernd [DE/DE]; Erdmannstrasse 44, 16540  
Hohen Neuendorf (DE). SCHWEDE, Wolfgang  
[DE/DE]; Maddeburger Strasse 41a, 16548 Glienicke  
(DE). SKUBALLA, Werner [DE/DE]; Mattersburger  
Weg 12, 13465 Berlin (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,  
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PI, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SI, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,  
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ,  
LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,  
MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU,  
SC, SD, SE, SG, SK, SI, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,  
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,  
SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität  
einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17  
Ziffer iii) für den folgenden Bestimmungsstaat US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes  
and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING C1-C15 FRAGMENTS OF EPOTHILONES AND THE DERIVATIVES THEREOF

(54) Bezeichnung: VERFAHREN FÜR DIE HERSTELLUNG VON C1-C15-FRAGMENTEN VON EPOTHILONEN UND DEREN DERIVATEN

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing C1-C15 fragments of epothilones and the derivatives thereof, whereby a C1-C6 fragment is bonded to a C7-C12 fragment to form a C1-C12 fragment which is then converted with a C13-C15 fragment to form the C1-C15 epothilone intermediate product to be produced. The thus produced C1-C15 epothilone intermediate products can be converted into the intrinsic active ingredients according to known methods. The invention also relates to the corresponding C1-C12 fragments.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung beschreibt ein Verfahren für die Herstellung von C1-C15-Fragmenten von Epothilonen und deren Derivaten, bei dem ein C1 - C6-Fragment mit einem C7 - C12-Fragment zu einem C1 - C12-Fragment verknüpft, und dieses dann mit einem C13 - C15-Fragment zu dem herzustellenden C1 - C15-Epothilon-Vorprodukt umgesetzt wird. Die so erhaltenen C1 - C15-Epothilon-Vorprodukte lassen sich nach bekannten Methoden zu den eigentlichen Wirkstoffen umsetzen. Die Erfindung betrifft außerdem die entsprechenden C1 - C12-Fragmente.

WO 2005/003071 A1